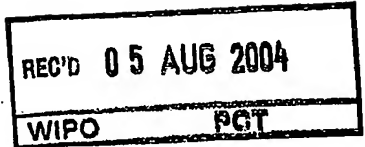


特 許 協 力 条 約

PCT



特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）
〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 3150WOOP	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/16656	国際出願日 (日.月.年) 25.12.2003	優先日 (日.月.年) 27.12.2002
国際特許分類 (IPC) Int.Cl ⁷ A61K45/00, A61K31/4245, A61P3/04, A61P43/00 // C07D413/10		
出願人 (氏名又は名称) 武田薬品工業株式会社		

<p>1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 7 ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。</p> <p><input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）</p> <p><input type="checkbox"/> 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。(実施細則第802号参照)</p>	
<p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第II欄 優先権</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見</p>	

国際予備審査の請求書を受理した日 27.01.2004	国際予備審査報告を作成した日 15.07.2004		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 大久保元浩	4C	8828
電話番号 03-3581-1101 内線 3452			

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
☐ PCT規則12.4にいう国際公開
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ*、 付けて国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ*、 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、 出願時に提出されたもの
 第 _____ 項*、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 第 _____ 項*、 付けて国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ 項*、 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
 第 _____ ページ/図*、 付けて国際予備審査機関が受理したもの
 第 _____ ページ/図*、 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

X 請求の範囲 14

請求の範囲 14 は、治療による人体の処置方法に係る態様を含むものであって、PCT 第 34 条 (4) (a) (i) 及び PCT 規則 6.7.1 (iv) の規定により、この国際予備審査機関が国際予備審査を行うことを要しない対象に係るものである。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲	1-13, 15	有 無
	請求の範囲		
進歩性(IS)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1-13, 15	
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲	1-13, 15	有 無
	請求の範囲		

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

- ・文献1: WO 02/15935 A1 (TAKEDA CHEM IND LTD) 2002.02.28 文献全体、claims、p.32第21行 & AU 2001/80135 B & JP 2002-138054 A & EP 131237 9 A1 & US 2003/187038 A
- ・文献2: WO 02/74340 A1 (TAKEDA CHEM IND LTD) 2002.09.26 文献全体、claims、p.46第13行 & JP 2003-212758 A & EP 1369130 A1
- ・文献3: WO 01/60410 A1 (TAKEDA CHEM IND LTD) 2001.08.23 文献全体、claims、p.38第19行 & AU 2001/32348 B & JP 2001-316296 A & EP 125825 4 A1 & US 2003/68374 A
- ・文献4: WO 01/60362 A1 (TAKEDA CHEM IND LTD) 2001.08.23 文献全体、claims、p.27第26行 & AU 2001/34088 B & JP 2001-302512 A & EP 126218 0 A1 & US 2003/55039 A
- ・文献5: WO 01/5428 A1 (TAKEDA CHEM IND LTD) 2001.01.25 文献全体、claims、p.3第8行 & JP 2001-89393 A & AU 2000/60197 B & EP 1197226 A1
- ・文献6: WO 02/15933 A2 (NOVARTIS AG) 2002.02.28 文献全体、claim7、p.5第26行 & AU 2001/87698 B & US 2004/34065 A
- ・文献7: WO 01/76573 A2 (NOVARTIS AG) 2001.10.18 文献全体、claim1 & AU 2001/58323 B & EP 1326604 A2 & JP 2003-530342 A US 2004/23840 A
- ・文献8: WO 01/76574 A2 (NOVARTIS AG) 2001.10.18 文献全体、claim1 & AU 2001/173938 B & EP 1282410 A2 & US 2003/83342 A & JP 2003-530343 A
- ・文献9: JP 11-43474 A (武田薬品工業株式会社) 1999.02.16 文献全体、p.14第26欄第13-31行 & EP 881212 A1 & CA 2238427 A1 & US 6177587 A

(文献1-9は、いずれも国際調査報告で引用された文献である)

第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/47573 A1 [E, X]	12. 06. 2003	02. 12. 2002	03. 12. 2001
WO 03/13609 A1 [E, X]	20. 02. 2003	01. 08. 2002	03. 08. 2001

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

(1)

請求の範囲1は、「アンギオテンシンII拮抗作用を有する」という所望の性質により定義された化合物を有効成分とする体重増加の抑制剤に関するものである。そして、請求の範囲1は、そのような性質を有するあらゆる化合物を包含するものであるが、PCT6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT5条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分にすぎないものと認められる。

また、「アンギオテンシンII拮抗作用を有する化合物」は、明細書第4頁第2.5行—第22ページ第10行及び出願時の技術常識を勘案しても、そのような性質を有する化合物の範囲を特定できないから、請求の範囲1は、PCT6条における明確性の要件も欠いている。

よって、本報告書では、「アンギオテンシンII拮抗作用を有する化合物」として実施例で具体的に採用されている請求の範囲12に規定される化合物、及び同化合物を含む請求の範囲11の式(I)で規定される化合物、を有効成分とする体重増加の抑制剤について行った先行技術調査の結果に基づいた見解につき、報告するものである。

(2)

candesartan cilexetil は、その化学構造からみて本願請求の範囲11規定の式(I)に包含される化合物であり（このことは請求の範囲13中に「カンデサルタンシレキセチル」が列記されていることから明らかである）、またアンギオテンシンII拮抗作用を有する化合物であることは本願優先日当時既知であったと認められる。

一方、国際調査報告で引用された、本願の優先日前に頒布された刊行物である

・NODA, M. et al. 'Involvement of angiotensin II in progression of renal injury in rats with genetic non-insulin-dependent diabetes mellitus (Wister fatty rats).' Japanese Journal of Pharmacology, 2001, vol. 85, no. 4, p. 416-422 文献全体、abstract、p. 418左欄下から第6-3行、Fig. 2

には、当該candesartan cilexetil (CC) が肥満に対し有益な効果をもたらさない結果を示すデータが記載されているところ、アンギオテンシンII拮抗作用を有する任意の化合物が体重増加の抑制作用を示す旨説明されている本願明細書の記載は、同データと矛盾している。

(3)

請求の範囲11中に「R1は陰イオンを形成しうる基またはそれに変じうる基を示し」とあるが、本願明細書第6—14頁の記載を参酌したとしても、かかる「陰イオンを形成しうる基またはそれに変じうる基」のとり得る基の範囲が明確に規定されているとはいえない。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

(1)

文献1-9には、請求の範囲1-13, 15のいずれかに規定される化合物と重複するアンジオテンシンII拮抗性化合物、及び、当該化合物を有効成分としてなる各種用途の医薬製剤について記載されており、同用途として抗肥満も挙げられている。肥満が過度な体重増加を伴うことは本願優先日前自明であることから、各文献1-9記載のいずれかに記載される上記アンジオテンシンII拮抗性化合物含有製剤を抗肥満剤として適用することにより、体重増加の抑制を見込むことは、当業者にとり容易である。

よって、請求の範囲1-13, 15はいずれも、文献1-9のいずれかにより進歩性を有さない。